

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成18年6月8日(2006.6.8)

【公表番号】特表2006-504631(P2006-504631A)

【公表日】平成18年2月9日(2006.2.9)

【年通号数】公開・登録公報2006-006

【出願番号】特願2003-587807(P2003-587807)

【国際特許分類】

C 0 7 D 417/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 417/06 C S P

A 6 1 K 31/506

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/00

C 0 7 D 417/14

【手続補正書】

【提出日】平成18年4月14日(2006.4.14)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

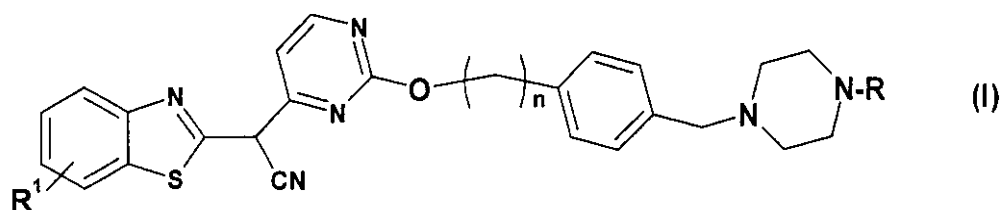
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I

【化1】



(式中、Rは、水素、 C_1-C_6 アルキル、 C_1-C_6 アルキルアリール、ヘテロアリール、 C_1-C_6 アルキルヘテロアリール、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルケニルアリール、 C_2-C_6 アルケニルヘテロアリール、 C_2-C_6 アルキニル、 C_2-C_6 アルキニルアリール、 C_2-C_6 アルキニルヘテロアリール、 C_3-C_8 シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、 C_1-C_6 アルキルシクロアルキル、 C_1-C_6 アルキルヘテロシクロアルキル、 C_1-C_6 アルキルカルボキシ、アシル、 C_1-C_6 アルキルアシル、アシルオキシ、 C_1-C_6 アルキルアシルオキシ、 C_1-C_6 アルキルアルコキシ、アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 アルキ

ルアルコキシカルボニル、アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノカルボニル、アシルアミノ、 C_1-C_6 アルキルアシルアミノ、ウレイド、 C_1-C_6 アルキルウレイド、アミノ、 C_1-C_6 アルキルアミノ、スルホニルオキシ、 C_1-C_6 アルキルスルホニルオキシ、スルホニル、 C_1-C_6 アルキルスルホニル、スルフィニル、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル、スルファニル、 C_1-C_6 アルキルスルファニル、スルホニルアミノ、 C_1-C_6 アルキルスルホニルアミノ、を含んで成る又はそれらから成る群から選択される；

R^1 は、H、ハロゲン、シアノ、ニトロ、アミノ、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、 C_1-C_6 アルキルアリール、アリール又はヘテロアリール、 C_1-C_6 アルキルヘテロアリール、 $-C(O)-OR^2$ 、 $-C(O)-R^2$ 、 $-C(O)NR^2$ 、 $-R^2$ 、 $-(SO_2)R^2$ を含んで成る又はそれらから成る群から選択され、但し、

R^2 と R^2' は、水素、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、アリール、ヘテロアリール、 C_1-C_6 アルキルアリール、 C_1-C_6 アルキルヘテロアリールを含んで成る又はそれらから成る群から独立して選択される；

n は0～3の整数である）に記載のピペラジンベンゾチアゾール誘導体、並びにその互変異性体、その幾何異性体、鏡像異性体としてのその光学活性形態、ジアステレオマー及びそのラセミ形態、並びに医薬として許容されるそれらの塩。

【請求項2】

R^1 が水素である、請求項1に記載のピペラジンベンゾチアゾール誘導体。

【請求項3】

R が水素、 C_1-C_3 アルキル、アミノカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアルコキシカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアルコキシ、 C_1-C_6 アルキルアシルオキシ、アルコキシカルボニル、 C_1-C_6 アルキルアミノカルボニルから成る群から選択される、請求項1又は2に記載のピペラジンベンゾチアゾール誘導体。

【請求項4】

R がH、又は C_1-C_3 アルキル、特にメチル又はエチル部分、あるいは C_1-C_6 アルキルアルコキシである、請求項3に記載のピペラジンベンゾチアゾール誘導体。

【請求項5】

n が1である、請求項1～4のいずれか1項に記載のピペラジンベンゾチアゾール誘導体。

【請求項6】

以下の：

1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル[2-({4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル]ベンジル} オキシ)ピリミジン-4-イル]アセトニトリル

1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル[2-({4-[(4-ベンジル-ピペラジン-1-イル)メチル]ベンジル} オキシ)ピリミジン-4-イル]アセトニトリル

1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル(2-{[4-(ピペラジン-1-イルメチル)ベンジル]オキシ}ピリミジン-4-イル)アセトニトリル

1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル[2-({4-[(4-ホルミルピペラジン-1-イル)メチル]ベンジル} オキシ)ピリミジン-4-イル]アセトニトリル

[2-({4-[(4-アセチルピペラジン-1-イル)メチル]ベンジル} オキシ)ピリミジン-4-イル](1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル)アセトニトリル

(3H-ベンゾチアゾール-2-イリデン)-{2-[4-(4-[1, 2, 4]オキサジアゾール-3-イルメチル-ピペラジン-1-イルメチル)-ベンジルオキシ]-ピリミジン-4-イル}-アセトニトリル

4-(4-{4-[(3H-ベンゾチアゾール-2-イリデン)-シアノ-メチル]-ピリミジン-2-イルオキシメチル}-ベンジル)-ピペラジン-1-カルボン酸メチルエステル

2-[4-(4-{4-[(3H-ベンゾチアゾール-2-イリデン)-シアノ-メチル]-ピリミジン-2-イルオキシメチル}-ベンジル)-ピペラジン-1-イル]-アセトアミド

(2- {4-[4-(2-アミノ-アセチル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンジル
オキシ}-ピリミジン-4-イル)-(3H-ベンゾチアゾール-2-イリデン)-アセ
トニトリル

[4-(4-{4-[(3H-ベンゾチアゾール-2-イリデン)-シアノ-メチル]-ピ
リミジン-2-イルオキシメチル}-ベンジル)-ピペラジン-1-イル]-酢酸メチル
エステル

(3H-ベンゾチアゾール-2-イリデン)-(2-{4-[4-(2-メトキシ-エチ
ル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンジルオキシ}-ピリミジン-4-イル)-ア
セトニトリル

4-(4-{4-[(3H-ベンゾチアゾール-2-イリデン)-シアノ-メチル]-ピ
リミジン-2-イルオキシメチル}-ベンジル)-ピペラジン-1-カルボン酸ジメチルア
ミド

(3H-ベンゾチアゾール-2-イリデン)-{2-[4-(4-エチル-ピペラジン-
1-イルメチル)-ベンジルオキシ]-ピリミジン-4-イル}-アセトニトリル

(3H-ベンゾチアゾール-2-イリデン)-(2-{4-[4-(2-ヒドロキシ-エ
チル)-ピペラジン-1-イルメチル]-ベンジルオキシ}-ピリミジン-4-イル)-
アセトニトリル

の群から選択される、請求項1～5のいずれか1項に記載のピペラジンベンゾチアゾール
誘導体。

【請求項7】

薬物としての使用のための、請求項1～6のいずれか1項に記載のピペラジンベンゾチ
アゾール誘導体。

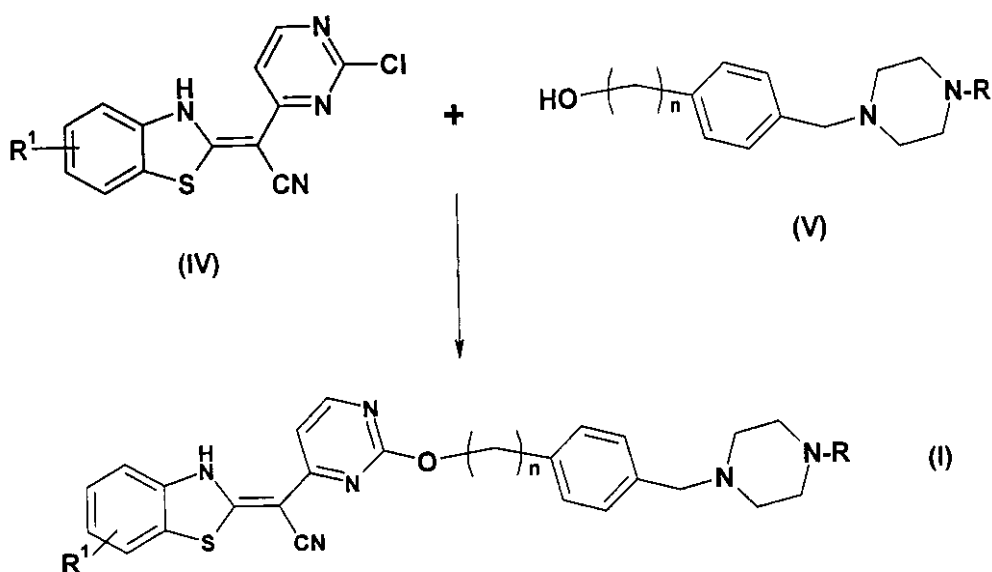
【請求項8】

脳虚血障害又はCNS障害の処置のための薬物の製造のための、請求項1～6のいずれ
か1項に記載のピペラジンベンゾチアゾール誘導体の使用。

【請求項9】

以下の段階：

【化2】



(R, R¹及びnは上述の通りである)

を含んで成る、請求項1～6のいずれか1項に記載のピペラジンベンゾチアゾール誘導体

の調製法。